

## ⑫ 公開特許公報(A)

昭61-87695

⑬ Int. Cl.<sup>4</sup> 識別記号 庁内整理番号 ⑭ 公開 昭和61年(1986)5月6日  
 C 07 K 7/20 6464-4H  
 A 61 K 37/24 A E E 7138-4C  
 // C 07 K 99:54 6464-4H 審査請求 未請求 発明の数 1 (全13頁)

⑮ 発明の名称 GnRH拮抗物質

⑯ 特 願 昭60-197532

⑰ 出 願 昭60(1985)9月6日

優先権主張 ⑱ 1984年9月7日 ⑲ 米国(US) ⑳ 648637

㉑ 発 明 者 ワイリー・ウオーカ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, バ  
ー・ベール・ジュニア ルデズ 1643

㉒ 発 明 者 ジャン・エドワール・ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, プ  
フレデリック・リベール ラックゴールド・ロード 9674

㉓ 出 願 人 ザ・サルク・インステ アメリカ合衆国カリフォルニア州ラ・ホーラ, ノース・ト  
チュート・フォー・バレー・バインズ・ロード 10010  
イオロジカル・スタデ  
ーズ

㉔ 代 理 人 弁理士 湯浅 恭三 外5名

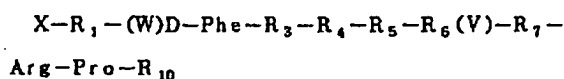
## 明 細 書

## 1. [ 発 明 の 名 称 ]

GnRH 拮 抗 物 質

## 2. [ 特 許 請 求 の 範 囲 ]

## (1) 次 式 :



[ 式中、Xは水素原子または7個以下の炭素原子を有するアシル基であり；

R<sub>1</sub>はデヒドロ-Pro, Pro, D-pGlu, D-Phe, D-Trp または β-D-NAL であり；

WはF, Cl, Cl<sub>2</sub>, Br, NO<sub>2</sub> または C<sup>α</sup>Me-Cl であり；

R<sub>2</sub>はD-Trp, (N<sup>10</sup>For)D-Trp または NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br または CH<sub>3</sub> で5位または6位が置換されたD-Trp であり；

R<sub>3</sub>はSer, Orn, AAL または nBu であり；

R<sub>4</sub>はTyr, (3F)Phe, (2F)Phe, (3I)Tyr, (3CH<sub>3</sub>)Phe, (2CH<sub>3</sub>)Phe, (3Cl)Phe または (2Cl)Phe であり；

R<sub>5</sub>はD-Lys, D-Orn または D-Dap であり；

Vは (arg-R<sup>1</sup>, R<sup>n</sup>)<sub>n</sub>(X) であり、ただし n は 1~5 であり、R<sup>1</sup>および R<sup>n</sup>はH、メチル、エチル、プロピルまたはブチルであり；

R<sub>7</sub>はLeu, NML, Nle または Nva であり；

そして

R<sub>10</sub>はGly-NH<sub>2</sub>, D-Ala-NH<sub>2</sub> または NH-Y であり、ただし Y は低級アルキル、シクロアルキル、フルオル低級アルキルまたは NH-CONH-Q (ここで Q は H または低級アルキルである) である]

で表わされるペプチドまたはその無塩性塩。

(2) R<sub>3</sub> が (6NO<sub>2</sub>)D-Trp であり、R<sub>6</sub> が D-Lys である特許請求の範囲第1項記載のペプチド。

(3) R<sub>1</sub> が β-D-2NAL である特許請求の範囲第1項または第2項記載のペプチド。

(4) V が Arg<sub>3</sub>(Ac) である特許請求の範囲第1~3項のいずれか1つに記載のペプチド。

(5) X が Ac である特許請求の範囲第1~4項のいずれか1つに記載のペプチド。